

Patent Abstracts of Japan

1

PUBLICATION NUMBER : 57035506
 PUBLICATION DATE : 26-02-82

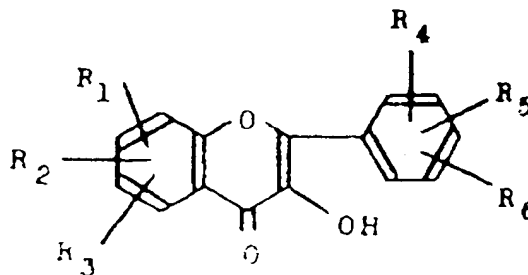
APPLICATION DATE : 11-08-80
 APPLICATION NUMBER : 55110836

APPLICANT : SANSO SEIYAKU KK;

INVENTOR : HONDA GORO;

INT.CL. : A61K 7/00

TITLE : BLEACHING COSMETIC



ABSTRACT : PURPOSE: To prepare a bleaching cosmetic completely nonirritant to the skin and having bleaching and sun-screening effects, by using a specific amount of flavonol compound other than quercetin.

CONSTITUTION: A bleaching cosmetic containing 0.001-0.01wt% of a flavonol compound of formula (R₁, R₂ and R₄ are H, OH or OCH₃; R₃, R₅ and R₆ are H or OH) other than quercetin, e.g. myricetin, as an active component. The flavonol compound may be a single compound or mixture, and can be prepared, e.g. by reacting the corresponding flavanone compound with amyl nitrite and hydrochloric acid, and hydrolyzing the resulted isonitroso derivative with an acid.

COPYRIGHT: (C)1982,JPO&Japio

① 日本国特許庁 (JP)
② 公開特許公報 (A)

① 特許出願公開
昭57-35506

③ Int. Cl.³
A 61 K 7/00

識別記号

庁内整理番号
7432-4C

④ 公開 昭和57年(1982)2月26日

発明の数 1
審査請求 有

(全 5 頁)

⑤ 色白化粧品

福岡県筑紫郡太宰府町大字大佐
野604の17

⑥ 特 願 昭55-110836

⑦ 出 願 人 三省製薬株式会社

⑧ 出 願 昭55(1980)8月11日

大野城市大字筒井1丁目6番地

⑨ 発 明 者 本田五郎

⑩ 代 理 人 弁理士 朝日奈宗太

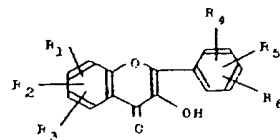
明 細 書

発 明 の 名 称

色白化粧品

特 許 請 求 の 範 囲

1 一般式 (I)



(I)

(式中、 R_1 、 R_2 および R_4 はH、OHまたは
 OCH_3 、 R_3 、 R_5 および R_6 はHまたはOHである)
を有するフラボノール系化合物(ただし、ク
ェルセチンを除く)を有効成分とし、かつ該
フラボノール系化合物の含有量が0.001重量
%から0.01重量%より少ない範囲である色白
化粧品。

3 発明の詳細な説明

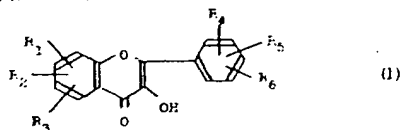
本発明は新規な色白化粧品に関する。さらに
詳しくは、フラボノール系化合物を有効成分と
して含有せしめた美白効果および日焼防止効果
の大なる色白化粧品に関する。

色白の美しい肌をしたいと願うのは女性の常
であり、従来より過酸化水素、過酸化亜鉛、過
酸化マグネシウム、過酸化ナトリウム、過ホウ
酸亜鉛、過ホウ酸マグネシウムまたは過ホウ酸
ナトリウムなどの過酸化物を配合した化粧品が
広く使用されていた。しかしながら前記のこ
とより過酸化物は保存性、物理的または化学的安定
性あるいは化粧品への配合性の面で問題があり、
かつその美白効果も充分ではなかった。近年に
なつて、ビタミンC、システイン、コロイド鉄
画などを配合した化粧品が開発され實用されて
いるが、これらとてもなお十分に満足しうる保
存性、安定性および美白効果を有するものとは
いいがたい。

これに対し本発明者は、さきにフラボノール

系であるクエルセチンがその美白効果および日
 焼防止効果にすぐれた活性を有しているという
 新たな事実を見出し、特許出願（特願昭53-
 165303号）をし、さらに他のフラボノール系化
 合物が前記クエルセチンと同様に人体皮膚内に
 存在するチロジナーゼの活性を阻害して顕著な
 メラニン生成抑制作用を示すと共に、すぐれた
 抗酸化作用や紫外線吸収作用を示し、そのため
 すぐれた美白効果および日焼防止効果を奏し、
 さらにこのものはクエルセチンと同様にpH、光、
 熱などに対する安定性が大きく保存性がすこぶ
 る良好であるなどの顕著な効果を奏しうるとい
 う新たな事実を見出し、特許出願（特願昭54-
 18753号）を行なった。

しかるに本発明者はその後さらに研究を重ねた
 結果、一般式、



ことにより、皮膚に対する刺激性などの心配が
 なく人体に対してまったく無害である。

本発明における前記一般式(I)を有するフラボ
 ノール系化合物の具体例としては、たとえば従
 来公知のミリセチン、ラムネチン、ロビネチン、
 クリソブレネチン、グチスセチン、フィセチ
 ン、ガラングニン、ヘルバセチン、5,7-ジメト
 キシ-フラボノールなどがあげられ、これら化
 合物は1種または2種以上を混合して使用され
 る。

これらの化合物は、たとえば相当するフラボ
 ノン系化合物に亜硫酸アミルと塩酸を反応させ、
 えられたイソニトロソ誘導体を酸で加水分解す
 る方法（S. v. Koetanecki et al., Ber., 37,
 773, 1402 (1904)および小沢光ら、薬誌、71,
 1183 (1951)）を利用して生成される。

本発明におけるフラボノール系化合物に類似
 する化合物としては、前記一般式(I)において3
 位に水酸基を有さないフラボン系化合物があげ
 られるが、かかるフラボン系化合物はインビ

特開昭57- 35506 (2)

（式中、 R_1 、 R_2 および R_4 はH、OHまたは $OOCH_3$ 、
 R_3 、 R_5 および R_6 はHまたはOHである）を有する
 フラボノール系化合物を有効成分とする色白化
 粧料において、該クエルセチンの含有量が
 0.001%（重量比、以下同様）から0.01%より少
 ない範囲であるときは皮膚に対する刺激性など
 の心配がまったくなく、しかも十分に満足しう
 る美白効果、日焼防止^{効果}を奏しうるといふ新たな
 事実を見出し、本発明を完成するにいたつた。

すなわち本発明の色白化粧料はその有効成分
 としてクエルセチンを除くフラボノール系化合
 物を特定の含有量で含有せしめたことを特徴と
 するものである。

かかるフラボノール系化合物はそれ自体強力
 なチロジナーゼ活性阻害能力を有し、かつすぐ
 れた抗酸化作用や紫外線吸収作用を有すると共
 に、光、pHに対する安定性が増加して保存安定
 性がきわめて良好であるなどのすぐれた美白効
 果および日焼防止効果を奏しうると共に、前述
 のごとき特定量のクエルセチンを含有せしめる

ロにおいてチロジナーゼ活性阻害能力を殆んど
 有しないものである。また前記フラボノール系
 化合物において、3位の水酸基で配糖体となる
 ばあい（たとえばルチン、クエルシトリンなど）
 も、同様に殆んどチロジナーゼ活性阻害能力を
 有しない。

本発明における前記フラボノール系化合物は
 その3位に水酸基を有しており、そのためその
 2、3および4位においておそくクト-エノ
 ール形の互変異性をとり、かつきわめて複雑な
 共鳴現象を起しているものと考えられる。しか
 して本発明におけるフラボノール系化合物は、
 その3位に水酸基を有していることによる前述
 のごとき現象によつて、強力にチロジナーゼ活
 性を阻害するものと考えられる。

本発明の色白化粧料は適宜の化粧料基材にか
 かるフラボノール系化合物を含有せしめたもの
 であるが、該フラボノール系化合物の含有量と
 しては前述のごとく0.001%から0.01%より少な
 い範囲が採用される。ただし、かかる範囲内で

人体に対してまったく無害であると共に十分に満足しうる美白効果、日焼防止効果が奏せられるのであつて前記範囲より多量に含有せしめるときは皮膚に対する刺激性の心配があり、一方前記範囲より少なく含有せしめるときは美白効果、日焼防止効果の面で若干の不安が残るからである。

以上述べたごとく本発明の色白化粧品は、美白剤および日焼防止剤として特定の含有量でフラボノール系化合物を含有せしめることにより、従来品の欠点を克服しえたものであつて、用いる化粧品基材などによつて何ら制限されるものではない。したがつて本発明においては、化粧品基材として従来より多用されている種々の基礎化粧品基材、たとえば各種アルコール類、動植物脂肪、界面活性剤、ベクタン、カルボキシメチルセルロース、アルギン酸塩、さらには安定剤、色素、香料およびその他の成分を適宜配合し、要すれば加熱溶融または希釈濃縮したものなどがすべてそのまま採用可能である。

かくしてえられた各リニメント剤のチロジナーゼ活性阻害能力を調べた結果をつぎに説明する。

試験管にL-チロジン溶液(0.3mg/ml)を1ml、マツクルベイン氏の試験液(pH6.8)を1ml、および前記リニメント剤の0.5mlを加えて、37℃の恒温水槽中で10分間インキュベートしたのち、これにチロジナーゼ溶液(1mg/ml)を0.1ml加えてよく攪拌し、ただちに分光光度計にセフトして475nmにおける吸光度を経時的に測定した。一方、ブランクテストして前記リニメント剤の代わりに水を用いて同様の吸光度測定を行なつた。

比較例1および2

フラボノール系化合物に代えてフラボン系化合物であるフラボンおよびルテオリンをそれぞれ用いた場合は実施例1と同様にして濃度0.005%の各リニメント剤を調製し、それらのチロジナーゼ活性阻害能力を調べた。

比較例3

つぎに実施例、比較例および処方例をあけて本発明の色白化粧料を説明する。

実施例1～10

次表に示す各フラボノール系化合物をそれぞれエタノールに溶解し、コハク酸あるいは炭酸カリウムでpHを6.0に調整して次表に示す濃度を有する各リニメント剤をえた。

実施例番号	フラボノール系化合物	リニメント剤中の濃度(%)
1	ミリセチン	0.005
2	ラムネチン	0.005
3	ロビネチン	0.005
4	クリソスプレネチン	0.005
5	グナスセチン	0.005
6	フィセチン	0.005
7	カラキン	0.005
8	ヘルバセチン	0.005
9	5,7-ジメチル-7-O-β-D-グルコピラノール	0.005
10	ミリセチンとグナスセチンとの重量比で1:1の混合物	0.005

フラボノール系化合物に代えてルチンを用いた場合は実施例1と同様にして濃度0.01%のリニメント剤を調製し、そのチロジナーゼ活性阻害能力を調べた。

前記実施例1および比較例1～3における各試験結果を添付図面(グラフ)に示す。このグラフから実施例1でえたりニメント剤は比較例1～3でえた各リニメント剤に比べて顕著なチロジナーゼ活性阻害能力を有していることがわかる。また実施例2～10でえた各リニメント剤のチロジナーゼ活性阻害能力は実施例1でえたりニメント剤のそれとはほぼ同じであつた。

つぎに本発明の色白化粧料の処方例のみに限定されるものではない。

処方例1(ローション)

(成分)	(重量配)
ミリセチン	0.005
アミノ酸類	0.20
増粘ポリドキシリン	0.05
フェノールスルホン酸亜鉛	0.30

を列挙するが、本発明はもとよりこれらの処方例

プロピレングリコール	8.00	ポリビニルアルコール	15.00
エタノール	5.00	ポリビニルピロリドン	4.00
精製水	86.445	ステアリン酸	2.00
香料および防腐剤	少量	フィーン 20	2.00
処方例 2 (バック)		スベン 60	0.50
(成 分)	(重量部)	プロピレングリコール	6.00
フィセチン	0.004	エタノール	10.00
ステアリン酸	4.00	精製水	69.795
アミノ酢酸	0.20	香料および防腐剤	少量
フェノールスルホン酸亜鉛	0.30	処方例 4 (ミルクローション)	
プロピレングリコール	13.00	(成 分)	(重量部)
カルボキシビニルポリマー	1.20	フィセチン	0.004
水酸化ナトリウム	0.14	ステアリン酸	2.00
エタノール	2.50	セタノール	0.50
酸化チタン	0.02	ラノリン	2.00
精製水	82.636	オレイルオレエート	2.00
香料および防腐剤	少量	スクワラン	3.00
処方例 3 (バック)		流動パラフィン	8.00
(成 分)	(重量部)	乳化剤	2.60
ダサセチン	0.005	トリエタノールアミン	1.00
プロピレングリコール	4.00	ラムネチン	0.004
精製水	74.994	ミツロウ	10.00
香料、酸化防止剤および防腐剤	少量	セレシン	7.00
処方例 5 (バニシングクリーム)		白色ワセリン	5.00
(成 分)	(重量部)	ラノリン	3.00
ガラシギン	0.005	ミリスチン酸イソプロピル	3.00
MCステアリン酸	6.00	スクワラン	4.00
ミツロウ	5.00	流動パラフィン	40.00
セタノール	3.00	ポリオキシエチレンセチルエーテル	2.70
ラノリン	2.00	乳化剤	2.30
ミリスチン酸イソプロピル	6.00	プロピレングリコール	2.00
流動パラフィン	7.00	精製水	23.096
オリーブ油	2.00	香料、酸化防止剤および防腐剤	少量
乳化剤	5.50		
トリエタノールアミン	0.60	4 図面の簡単な説明	
プロピレングリコール	3.00	図面は実施例 1 および比較例 1 ～ 3 でえた各	
精製水	57.795	リニメント剤のチロジナーゼ活性阻害能力を示	
香料、酸化防止剤および防腐剤	少量	すための着色度と時間との関係を示すグラフで	
処方例 6 (コールドクリーム)		ある。	
(成 分)	(重量部)		

